

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
21. Dezember 2000 (21.12.2000)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 00/76550 A2

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A61K 47/48**
- (21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP00/05254**
- (22) Internationales Anmeldedatum:
7. Juni 2000 (07.06.2000)
- (25) Einreichungssprache: **Deutsch**
- (26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**
- (30) Angaben zur Priorität:
199 26 475.9 10. Juni 1999 (10.06.1999) **DE**
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **KTB TUMORFORSCHUNGSGESELLSCHAFT MBH [DE/DE]**; Breisacher Strasse 117, D-79106 Freiburg im Breisgau (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **KRATZ, Felix** [DE/DE]; Zum Abtsweingarten 19, 79241 Ihringen (DE).
- (74) Anwalt: **PERREY, Ralf; Müller-Boré & Partner, Grafinger Strasse 2, D-81671 München (DE).**
- (81) Bestimmungsstaaten (national): **AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.**
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): **ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).**
- Veröffentlicht:**
— Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: **CARRIER-DRUG CONJUGATE**

(54) Bezeichnung: **TRÄGER-PHARMAKA-KONJUGATE**

(57) Abstract: The invention relates to a carrier-drug conjugate comprising a carrier containing a polypeptide sequence having one or several cysteine radicals and a pharmakon containing a pharmaceutical and/or diagnostic active substance, a spacer molecule and a thiol binding group, whereby over 0.7 mol pharmakon per mol of cysteine radical is bound to the carrier by the thiol binding group. The invention also relates to a method for the production of said conjugate and to medicaments and diagnostic kits containing said conjugate.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft Träger-Pharmaka-Konjugate, umfassend einen Träger, enthaltend eine Polypeptidsequenz mit einem oder mehreren Cystein-Resten, und ein Pharmakon, enthaltend eine pharmazeutisch und/oder diagnostisch aktive Substanz, ein Spacermolekül und eine thiolbindende Gruppe, wobei pro Mol Cystein-Rest mehr als 0,7 Mol Pharmakon über die thiolbindende Gruppe an den Träger gebunden sind, sowie Verfahren zu deren Herstellung und Arzneimittel und diagnostische Kits, welche die Konjugate enthalten.

WO 00/76550 A2